

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
9. September 2005 (09.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/082871 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 277/48**,  
417/04, 277/82, 285/12, 285/08, 249/14, 237/22, 231/56,  
263/28, 261/14, A61K 31/425

(74) **Anwalt: DIETEL, Anja**; Grünecker, Kinkeldey, Stock-  
mair & Schwanhäusser, Maximilianstrasse 58, 80538  
München (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/001521

(81) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,  
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum:  
15. Februar 2005 (15.02.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) **Angaben zur Priorität:**  
10 2004 008 141.7  
19. Februar 2004 (19.02.2004) DE

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,  
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) **Anmelder** (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **ABBOTT GMBH & CO. KG** [DE/DE];  
Max-Planck-Ring 2, 65205 Wiesbaden (DE).

(72) **Erfinder; und**

(75) **Erfinder/Anmelder** (nur für US): **NETZ, Astrid**  
[DE/DE]; Mönchwörthstrasse 62, 68199 Mannheim  
(DE). **AMBERG, Wilhelm** [DE/DE]; Rastatter Str. 55,  
68239 Mannheim (DE). **LANGE, Udo** [DE/DE]; Wil-  
helm-Blos-Str. 10, 68199 Mannheim (DE). **OCHSE,**  
**Michael** [DE/DE]; Goethestr. 4, 67098 Bad Dürkheim  
(DE). **HUTCHINS, Charles, W.** [US/US]; 31005  
Prairie Ridge Rd, Green Oaks, IL 60058 (US). **GAR-**  
**CIA-LADONA, Francisco-Xavier** [DE/DE]; Brehm-  
strasse 107i, 76870 Kandel (DE). **WERNET, Wolfgang**  
[DE/DE]; Freiheitstrasse 73, 67434 Neustadt/Weinstrasse  
(DE). **KLING, Andreas** [DE/DE]; Riegeler Weg 14,  
68239 Mannheim (DE).

**Veröffentlicht:**

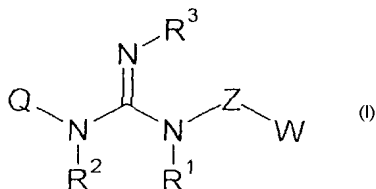
— mit internationalem Recherchenbericht  
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden  
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen  
eintreffen

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts:** 10. November 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** GUANIDINE COMPOUNDS, AND USE THEREOF AS BINDING PARTNERS FOR 5-HT<sub>5</sub> RECEPTORS

(54) **Bezeichnung:** GUANIDINVERBINDUNGEN UND IHRE VERWENDUNG ALS BINDUNGSPARTNER FÜR 5-HT<sub>5</sub>-RE-  
ZEPTOREN



(57) **Abstract:** The invention relates to guanidine compounds of general formula (I),  
corresponding enantiomeric, diastereomeric, and/or tautomeric forms thereof, and phar-  
maceutically acceptable salts thereof. The invention further relates to the use of guani-  
dine compounds as binding partners for 5-HT<sub>5</sub> receptors in order to treat diseases mod-  
ulated by 5-HT<sub>5</sub> receptor activity, especially treat neurodegenerative and neuropsychi-  
atric disorders and the signs, symptoms, and malfunctions associated therewith.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft Guanidinverbindungen  
der allgemeinen Formel (I) entsprechende enantiomere, diastereomere und/oder tautomere Formen davon sowie pharmazeutisch  
annehmbare Salze davon. Weiterhin betrifft die vorliegende Verbincaung die Verwendung von Guanidinverbindungen als Bin-  
dungspartner für 5-HT<sub>5</sub>-Rezeptoren zur Behandlung von Krankheiten, die durch eine 5-HT<sub>5</sub>-Rezeptoraktivität moduliert werden,  
insbesondere zur Behandlung von neurodegenerativen und neuropsychiatrischen Störungen sowie den damit zusammenhängenden  
Anzeichen, Symptomen und Fehlfunktionen.



WO 2005/082871 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2005/001521

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D277/48 C07D417/04 C07D277/82 C07D285/12 C07D285/08  
C07D249/14 C07D237/22 C07D231/56 C07D263/28 C07D261/14  
A61K31/425

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 5. 2-(Substituted guanidino)-4-arylthiazoles and Aryloxazole Analogues" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, CODEN: JMCMAR, vol. 45, no. 1, 2002, pages 143-150, XP002339344 ISSN: 0022-2623 examples 39-41,44,46-49 ----- -/--	1,12,13

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

24 August 2005

Date of mailing of the international search report

22/09/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Von Daacke, A

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 4. 2-(Substituted guanidino)-4-phenylthiazoles and Some Structurally Rigid Derivatives" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, vol. 43, no. 17, 2000, pages 3315-3321, XP002339345 ISSN: 0022-2623 examples 36-42	1,12,13
X	----- HOGBERG, MARITA ET AL: "Bioisosteric modification of PTT-HIV-1 RT-inhibitors: synthesis and biological evaluation" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS , CODEN: BMCLE8, vol. 10, no. 3, 2000, pages 265-268, XP002339346 ISSN: 0960-894X tables 1,2	1,12,13
X	----- KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori agents. 3. 2-(Arylalkyl)guanidino-4- furylthiazoles" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, vol. 42, no. 15, 1999, pages 2920-2926, XP002339347 ISSN: 0022-2623 table 1	1,12,13
X	----- GUPTA, S. ET AL: "Superpendentic Index: A novel topological descriptor for predicting biological activity" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES , CODEN: JCISD8, vol. 39, no. 2, 1999, pages 272-277, XP002339348 ISSN: 0095-2338 examples 8,27	1,12,13
X	----- DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of furylthiazoles as ulcer inhibitors" XP002341494 retrieved from STN Database accession no. 1997:195723 RN 187592-36-5;187592-37-6;187592_38-7;187592 -39-8;187592-38-7;187592-40-1;187592-41-2. abstract -/--	1,12,13

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>&amp; JP 09 040671 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 10 February 1997 (1997-02-10)</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of guanidinothiazole derivatives as histamine H2 antagonists" XP002341495 retrieved from STN Database accession no. 1997:140933 RN186686-50-0;186686-62-4;186686-61-3;1866 86-70-4;186686-69-1;186686-76-0;186686-87- 3;1876686-75-9;186686-86-2;186686-90-8;186 686-96-4;186686-99-7;186687-00-3;186686-01 -4. abstract &amp; JP 08 337579 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 24 December 1996 (1996-12-24)</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KAWANISHI, YASUYUKI ET AL: "Synthesis and biological evaluation of a new reversely linked type of dual histamine H2 and gastrin receptor antagonist" XP002341496 retrieved from STN Database accession no. 1997:81087 RN 187816-96-2;187816-97-3. abstract &amp; CHEMICAL &amp; PHARMACEUTICAL BULLETIN CODEN: CPBTAL, vol. 45, no. 1, 1997, pages 116-124, ISSN: 0009-2363</p> <p>-----</p>	1,12,13
X	<p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; "Preparation of 4-thienylthiazole derivatives as antiulcer and antibacterial agents" XP002341497 retrieved from STN Database accession no. 1997:42 RN184581-58-6 und alle weiteren Verbindungen bis einschliesslich 184582-15-8. abstract &amp; JP 08 245621 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 24 September 1996 (1996-09-24)</p> <p>-----</p> <p>-/--</p>	1,12,13

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/001521

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 96/05187 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 22 February 1996 (1996-02-22) Ansprüche; Beispiele 3,10 und 11. -----	1,12,13
X	WO 95/18126 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 6 July 1995 (1995-07-06) Ansprüche; Beispiele 1 (15-24), etc. -----	1,12,13
X	GOEL, ANSHU ET AL: "Structure-Activity Study on Antiulcer Agents Using Wiener's Topological Index and Molecular Connectivity Index" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES, CODEN: JCISD8, vol. 35, no. 3, 1995, pages 504-509, XP002339349 ISSN: 0095-2338 examples 8,27 -----	1,12,13
X	EP 0 545 376 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 9 June 1993 (1993-06-09) claims 1-13; example 6(3) -----	1,12,13
X	WO 92/16526 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 1 October 1992 (1992-10-01) claims 1-10; example 49 -----	1,12,13
X	EP 0 259 085 A1 (PFIZER INC., USA) 9 March 1988 (1988-03-09) claims 1-6; example 15(2) -----	1,12,13
X	US 4 560 690 A (REITER, LAWRENCE ALAN) 24 December 1985 (1985-12-24) claims 1-27; examples 6p-6u -----	1,12,13
X	JP 59 036674 A (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 28 February 1984 (1984-02-28) Verbindungen 9,10, abstract -----	1,12,13
X	WO 02/16318 A (PACIFIC CORPORATION; SUH, YOUNG, GER; OH, UH, TAEK; KIM, HEE, DOO; LEE) 28 February 2002 (2002-02-28) the whole document -----	1-22
X	WO 99/20599 A (CAMBRIDGE NEUROSCIENCE, INC) 29 April 1999 (1999-04-29) the whole document -----	1-22
	----- -/--	

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/001521

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/36544 A (TOKUYAMA CORPORATION; WATANABE, SHIN; KAWAHARA, MIZUE) 10 May 2002 (2002-05-10) the whole document	1-22
X	GB 1 031 165 A (THE WELLCOME FOUNDATION LIMITED) 25 May 1966 (1966-05-25) the whole document	1-22

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/001521

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 9040671	A	10-02-1997	NONE	
JP 8337579	A	24-12-1996	NONE	
JP 8245621	A	24-09-1996	NONE	
WO 9605187	A1	22-02-1996	AU 3192995 A JP 2000504305 T	07-03-1996 11-04-2000
WO 9518126	A1	06-07-1995	AU 1283195 A JP 9507222 T	17-07-1995 22-07-1997
EP 0545376	A1	09-06-1993	AT 170851 T AU 666893 B2 AU 2983792 A CA 2084640 A1 CN 1079469 A DE 69226931 D1 DE 69226931 T2 HU 65776 A2 HU 9500396 A3 JP 2531329 B2 JP 6321921 A MX 9206930 A1 US 5532258 A ZA 9208876 A	15-09-1998 29-02-1996 10-06-1993 07-06-1993 15-12-1993 15-10-1998 18-03-1999 28-07-1994 28-09-1995 04-09-1996 22-11-1994 01-06-1993 02-07-1996 15-07-1993
WO 9216526	A1	01-10-1992	CA 2105981 A1 EP 0575614 A1 JP 6505724 T US 5364871 A	14-09-1992 29-12-1993 30-06-1994 15-11-1994
EP 0259085	A1	09-03-1988	AT 66477 T DE 3772301 D1 DK 451687 A ES 2031514 T3 GR 3002596 T3 IE 60039 B1 JP 1910156 C JP 6033258 B JP 63063678 A PT 85604 A , B US 5026715 A	15-09-1991 26-09-1991 13-05-1988 16-12-1992 25-01-1993 18-05-1994 09-03-1995 02-05-1994 22-03-1988 01-09-1987 25-06-1991
US 4560690	A	24-12-1985	AR 241784 A1 AT 44741 T AU 554271 B2 AU 4179085 A CA 1262352 A1 CN 85103265 A , B CS 248741 B2 CS 248750 B2 DD 233374 A5 DE 3571618 D1 DK 190885 A , B, EG 17391 A EP 0161841 A1 ES 8605511 A1	30-12-1992 15-08-1989 14-08-1986 07-11-1985 17-10-1989 10-12-1986 12-02-1987 12-02-1987 26-02-1986 24-08-1989 31-10-1985 30-12-1992 21-11-1985 01-09-1986

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/001521

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 4560690	A		ES 8606336 A1 FI 851683 A ,B, GR 851020 A1 HU 37787 A2 IL 75038 A IN 165501 A1 JP 1470507 C JP 60239474 A JP 63016387 B KR 8700925 B1 KR 8700924 B1 MX 9203542 A1 NO 851695 A ,B, NZ 211909 A PH 21824 A PL 253107 A1 PL 257845 A1 PT 80361 A ,B SU 1380614 A3 SU 1400508 A3 YU 72385 A1 YU 114587 A1 ZA 8503161 A	01-10-1986 31-10-1985 25-11-1985 28-02-1986 31-07-1988 04-11-1989 14-12-1988 28-11-1985 08-04-1988 07-05-1987 07-05-1987 01-09-1992 31-10-1985 30-03-1988 04-03-1988 03-06-1986 07-10-1986 01-05-1985 07-03-1988 30-05-1988 29-02-1988 29-02-1988 30-12-1986
JP 59036674	A	28-02-1984	NONE	
WO 0216318	A	28-02-2002	AU 8022901 A AU 8023001 A CA 2417507 A1 CN 1418191 A EP 1303483 A1 EP 1311478 A1 JP 2004506713 T JP 2004506714 T WO 0216318 A1 WO 0216319 A1 KR 2002039226 A KR 2002030009 A NZ 523882 A US 2003153596 A1 US 2003212140 A1	04-03-2002 04-03-2002 28-02-2002 14-05-2003 23-04-2003 21-05-2003 04-03-2004 04-03-2004 28-02-2002 28-02-2002 25-05-2002 22-04-2002 26-11-2004 14-08-2003 13-11-2003
WO 9920599	A	29-04-1999	AU 1362699 A CA 2307597 A1 EP 1032556 A1 JP 2001520215 T WO 9920599 A1	10-05-1999 29-04-1999 06-09-2000 30-10-2001 29-04-1999
WO 0236544	A	10-05-2002	JP 2002145837 A CN 1473145 A EP 1338588 A1 WO 0236544 A1 US 2004102646 A1	22-05-2002 04-02-2004 27-08-2003 10-05-2002 27-05-2004
GB 1031165	A	25-05-1966	DE 1518231 A1	30-04-1970



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/001521

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> IPK 7 C07D277/48 C07D417/04 C07D277/82 C07D285/12 C07D285/08 C07D249/14 C07D237/22 C07D231/56 C07D263/28 C07D261/14 A61K31/425		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b> Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 C07D		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 5. 2-(Substituted guanidino)-4-arylthiazoles and Aryloxazole Analogues" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, CODEN: JMCMAR, Bd. 45, Nr. 1, 2002, Seiten 143-150, XP002339344 ISSN: 0022-2623 Beispiele 39-41,44,46-49 ----- -/--	1,12,13
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div> <input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen         </div> <div> <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie         </div> </div>		
<div style="display: flex;"> <div style="flex: 1;"> <p>* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</p> <p>*A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>*E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</p> <p>*O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>*P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> </div> <div style="flex: 1;"> <p>*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</p> <p>*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>*Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</p> <p>*Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p> </div> </div>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
24. August 2005		22/09/2005
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  Von Daacke, A

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori Agents. 4. 2-(Substituted guanidino)-4-phenylthiazoles and Some Structurally Rigid Derivatives" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, Bd. 43, Nr. 17, 2000, Seiten 3315-3321, XP002339345 ISSN: 0022-2623 Beispiele 36-42	1,12,13
X	HOGBERG, MARITA ET AL: "Bioisosteric modification of PTT-HIV-1 RT-inhibitors: synthesis and biological evaluation" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS , CODEN: BMCLE8, Bd. 10, Nr. 3, 2000, Seiten 265-268, XP002339346 ISSN: 0960-894X Tabellen 1,2	1,12,13
X	KATSURA, YOUSUKE ET AL: "Anti-Helicobacter pylori agents. 3. 2-[(Arylalkyl)guanidino]-4- furylthiazoles" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , CODEN: JMCMAR, Bd. 42, Nr. 15, 1999, Seiten 2920-2926, XP002339347 ISSN: 0022-2623 Tabelle 1	1,12,13
X	GUPTA, S. ET AL: "Superpendentic Index: A novel topological descriptor for predicting biological activity" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES , CODEN: JCISD8, Bd. 39, Nr. 2, 1999, Seiten 272-277, XP002339348 ISSN: 0095-2338 Beispiele 8,27	1,12,13
X	DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of furylthiazoles as ulcer inhibitors" XP002341494 gefunden im STN Database accession no. 1997:195723 RN 187592-36-5;187592-37-6;187592_38-7;187592 -39-8;187592-38-7;187592-40-1;187592-41-2. Zusammenfassung -/-	1,12,13

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>&amp; JP 09 040671 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 10. Februar 1997 (1997-02-10)</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KATSURA, YOSUKE ET AL: "Preparation of guanidinothiazole derivatives as histamine H2 antagonists" XP002341495 gefunden im STN Database accession no. 1997:140933 RN186686-50-0;186686-62-4;186686-61-3;1866 86-70-4;186686-69-1;186686-76-0;186686-87- 3;1876686-75-9;186686-86-2;186686-90-8;186 686-96-4;186686-99-7;186687-00-3;186686-01 -4. Zusammenfassung &amp; JP 08 337579 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO, JAPAN) 24. Dezember 1996 (1996-12-24)</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KAWANISHI, YASUYUKI ET AL: "Synthesis and biological evaluation of a new reversely linked type of dual histamine H2 and gastrin receptor antagonist" XP002341496 gefunden im STN Database accession no. 1997:81087 RN 187816-96-2;187816-97-3. Zusammenfassung &amp; CHEMICAL &amp; PHARMACEUTICAL BULLETIN CODEN: CPBTAL, Bd. 45, Nr. 1, 1997, Seiten 116-124, ISSN: 0009-2363</p> <p>-----</p> <p>DATABASE CAPLUS 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; "Preparation of 4-thienylthiazole derivatives as antiulcer and antibacterial agents" XP002341497 gefunden im STN Database accession no. 1997:42 RN184581-58-6 und alle weiteren Verbindungen bis einschliesslich 184582-15-8. Zusammenfassung &amp; JP 08 245621 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 24. September 1996 (1996-09-24)</p> <p>-----</p> <p>-/--</p>	<p>1,12,13</p> <p>1,12,13</p> <p>1,12,13</p>

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie <sup>a</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 96/05187 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 22. Februar 1996 (1996-02-22) Ansprüche; Beispiele 3,10 und 11. -----	1,12,13
X	WO 95/18126 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 6. Juli 1995 (1995-07-06) Ansprüche; Beispiele 1 (15-24), etc. -----	1,12,13
X	GOEL, ANSHU ET AL: "Structure-Activity Study on Antiulcer Agents Using Wiener's Topological Index and Molecular Connectivity Index" JOURNAL OF CHEMICAL INFORMATION AND COMPUTER SCIENCES, CODEN: JCISD8, Bd. 35, Nr. 3, 1995, Seiten 504-509, XP002339349 ISSN: 0095-2338 Beispiele 8,27 -----	1,12,13
X	EP 0 545 376 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 9. Juni 1993 (1993-06-09) Ansprüche 1-13; Beispiel 6(3) -----	1,12,13
X	WO 92/16526 A1 (FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 1. Oktober 1992 (1992-10-01) Ansprüche 1-10; Beispiel 49 -----	1,12,13
X	EP 0 259 085 A1 (PFIZER INC., USA) 9. März 1988 (1988-03-09) Ansprüche 1-6; Beispiel 15(2) -----	1,12,13
X	US 4 560 690 A (REITER, LAWRENCE ALAN) 24. Dezember 1985 (1985-12-24) Ansprüche 1-27; Beispiele 6p-6u -----	1,12,13
X	JP 59 036674 A (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD., JAPAN) 28. Februar 1984 (1984-02-28) Verbindungen 9,10, Zusammenfassung -----	1,12,13
X	WO 02/16318 A (PACIFIC CORPORATION; SUH, YOUNG, GER; OH, UH, TAEK; KIM, HEE, DOO; LEE) 28. Februar 2002 (2002-02-28) das ganze Dokument -----	1-22
X	WO 99/20599 A (CAMBRIDGE NEUROSCIENCE, INC) 29. April 1999 (1999-04-29) das ganze Dokument -----	1-22
	----- -/--	

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/001521

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/36544 A (TOKUYAMA CORPORATION; WATANABE, SHIN; KAWAHARA, MIZUE) 10. Mai 2002 (2002-05-10) das ganze Dokument	1-22
X	GB 1 031 165 A (THE WELLCOME FOUNDATION LIMITED) 25. Mai 1966 (1966-05-25) das ganze Dokument	1-22

# INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/001521

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
JP 9040671	A	10-02-1997	KEINE	
JP 8337579	A	24-12-1996	KEINE	
JP 8245621	A	24-09-1996	KEINE	
WO 9605187	A1	22-02-1996	AU 3192995 A JP 2000504305 T	07-03-1996 11-04-2000
WO 9518126	A1	06-07-1995	AU 1283195 A JP 9507222 T	17-07-1995 22-07-1997
EP 0545376	A1	09-06-1993	AT 170851 T AU 666893 B2 AU 2983792 A CA 2084640 A1 CN 1079469 A DE 69226931 D1 DE 69226931 T2 HU 65776 A2 HU 9500396 A3 JP 2531329 B2 JP 6321921 A MX 9206930 A1 US 5532258 A ZA 9208876 A	15-09-1998 29-02-1996 10-06-1993 07-06-1993 15-12-1993 15-10-1998 18-03-1999 28-07-1994 28-09-1995 04-09-1996 22-11-1994 01-06-1993 02-07-1996 15-07-1993
WO 9216526	A1	01-10-1992	CA 2105981 A1 EP 0575614 A1 JP 6505724 T US 5364871 A	14-09-1992 29-12-1993 30-06-1994 15-11-1994
EP 0259085	A1	09-03-1988	AT 66477 T DE 3772301 D1 DK 451687 A ES 2031514 T3 GR 3002596 T3 IE 60039 B1 JP 1910156 C JP 6033258 B JP 63063678 A PT 85604 A ,B US 5026715 A	15-09-1991 26-09-1991 13-05-1988 16-12-1992 25-01-1993 18-05-1994 09-03-1995 02-05-1994 22-03-1988 01-09-1987 25-06-1991
US 4560690	A	24-12-1985	AR 241784 A1 AT 44741 T AU 554271 B2 AU 4179085 A CA 1262352 A1 CN 85103265 A ,B CS 248741 B2 CS 248750 B2 DD 233374 A5 DE 3571618 D1 DK 190885 A ,B, EG 17391 A EP 0161841 A1 ES 8605511 A1	30-12-1992 15-08-1989 14-08-1986 07-11-1985 17-10-1989 10-12-1986 12-02-1987 12-02-1987 26-02-1986 24-08-1989 31-10-1985 30-12-1992 21-11-1985 01-09-1986

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/001521

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 4560690 A		ES 8606336 A1	01-10-1986
		FI 851683 A ,B,	31-10-1985
		GR 851020 A1	25-11-1985
		HU 37787 A2	28-02-1986
		IL 75038 A	31-07-1988
		IN 165501 A1	04-11-1989
		JP 1470507 C	14-12-1988
		JP 60239474 A	28-11-1985
		JP 63016387 B	08-04-1988
		KR 8700925 B1	07-05-1987
		KR 8700924 B1	07-05-1987
		MX 9203542 A1	01-09-1992
		NO 851695 A ,B,	31-10-1985
		NZ 211909 A	30-03-1988
		PH 21824 A	04-03-1988
		PL 253107 A1	03-06-1986
		PL 257845 A1	07-10-1986
		PT 80361 A ,B	01-05-1985
		SU 1380614 A3	07-03-1988
		SU 1400508 A3	30-05-1988
		YU 72385 A1	29-02-1988
		YU 114587 A1	29-02-1988
		ZA 8503161 A	30-12-1986
JP 59036674 A	28-02-1984	KEINE	
WO 0216318 A	28-02-2002	AU 8022901 A	04-03-2002
		AU 8023001 A	04-03-2002
		CA 2417507 A1	28-02-2002
		CN 1418191 A	14-05-2003
		EP 1303483 A1	23-04-2003
		EP 1311478 A1	21-05-2003
		JP 2004506713 T	04-03-2004
		JP 2004506714 T	04-03-2004
		WO 0216318 A1	28-02-2002
		WO 0216319 A1	28-02-2002
		KR 2002039226 A	25-05-2002
		KR 2002030009 A	22-04-2002
		NZ 523882 A	26-11-2004
		US 2003153596 A1	14-08-2003
		US 2003212140 A1	13-11-2003
WO 9920599 A	29-04-1999	AU 1362699 A	10-05-1999
		CA 2307597 A1	29-04-1999
		EP 1032556 A1	06-09-2000
		JP 2001520215 T	30-10-2001
		WO 9920599 A1	29-04-1999
WO 0236544 A	10-05-2002	JP 2002145837 A	22-05-2002
		CN 1473145 A	04-02-2004
		EP 1338588 A1	27-08-2003
		WO 0236544 A1	10-05-2002
		US 2004102646 A1	27-05-2004
GB 1031165 A	25-05-1966	DE 1518231 A1	30-04-1970